

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
26. Mai 2005 (26.05.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/046561 A2

- (51) Internationale Patentklassifikation⁷: **A61K**
- (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/010300
- (22) Internationales Anmeldedatum:
15. September 2004 (15.09.2004)
- (25) Einreichungssprache: Deutsch
- (26) Veröffentlichungssprache: Deutsch
- (30) Angaben zur Priorität:
103 53 196.3 13. November 2003 (13.11.2003) DE
- (71) Anmelder (*für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US*): RÖHM GMBH & CO. KG [DE/DE]; Kirschenallee, 64293 Darmstadt (DE).
- (72) Erfinder; und
- (75) Erfinder/Anmelder (*nur für US*): LIZIO, Rosario [IT/DE]; Rossbergweg 7L, 64380 Rossdorf (DE). PETEREIT, Hans-Ulrich [DE/DE]; Händelstrasse 40, 64291 Darmstadt (DE). ASSMUS, Manfred [DE/DE]; Erbsengasse 9, 64404 Bickenbach (DE). RAVISHANKAR, Hema [IN/IN]; Chheda Nagar, Chembur, Mumbai 400089 (IN).
- (81) Bestimmungsstaaten (*soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart*): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) Bestimmungsstaaten (*soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart*): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

- ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu veröffentlichen nach Erhalt des Berichts

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: MULTILAYER DOSAGE FORM COMPRISING A MATRIX THAT INFLUENCES RELEASE OF A MODULATOR SUBSTANCE

(54) Bezeichnung: MEHRSCHEINTIGE ARZNEIFORM MIT EINER DIE ABGABE EINER MODULATORISCHEN SUBSTANZ BEEINFLUSSENDEN MATRIX

(57) Abstract: The invention relates to a multilayer dosage form for the controlled release of active substances, which substantially comprises a) optionally a neutral core (nonpareilles), b) an inner control layer, comprising a modulatory effective substance that is embedded in a matrix that influences release of a modulatory substance, said matrix comprising pharmaceutically acceptable polymers, waxes, resins and/or proteins and optionally an active substance, c) an active substance layer, comprising a pharmaceutically active substance and optionally a modulatory effective substance, d) an outer control layer, comprising at least 60 % by weight of one or more mixtures from a plurality of (meth)acrylate copolymers, 98 to 85 C₁ to C₄ alkyl esters of the (meth)acrylic acid and 2 to 15 % by weight of methacrylate monomers with a quaternary ammonium group in the alkyl group, and optionally up to 40 % by weight of additional pharmaceutically acceptable polymers. The dosage form is further characterized in that the layers additionally contain, in a manner known per se, pharmaceutically common adjuvants.

WO 2005/046561 A2

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft eine mehrschichtige Arzneiform für die kontrollierte Wirkstofffreisetzung, enthaltend im wesentlichen a) optional einen neutralen Kern (Nonpareilles), b) eine innere Kontrollschicht, enthaltend eine modulatorisch wirkende Substanz, die in einer die Abgabe der modulatorischen Substanz beeinflussende Matrix eingebettet ist, die pharmazeutisch verwendbare - Polymere, Wachse, Harze und/oder Proteine sowie gegebenenfalls einen Wirkstoff enthält, c) eine Wirkstoffschicht, enthaltend einen pharmazeutischen Wirkstoff und gegebenenfalls eine modulatorisch wirkende Substanz, d) eine äußere Kontrollsicht, enthaltend zu mindestens 60 Gew.-% ein oder eine Mischung aus mehreren (Meth)acrylatcopolymeren, aus 98 bis 85 C₁- bis C₄-Alkylestern der (Meth)acrylsäure und 2 bis 15 Gew.-% Methacrylatmonomeren mit einer quaternären Ammoniumgruppe im Alkylrest, und gegebenenfalls bis zu 40 Gew.-% weitere pharmazeutisch verwendbare Polymere, wobei die Schichten zusätzlich und in an sich bekannter Weise pharmazeutisch übliche Hilfsstoffe enthalten können.